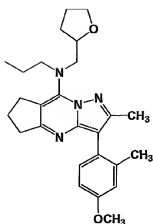


TLC : Rf 0.79 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.57 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.44 (brd, J = 8.1Hz, 2H),
 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.91 (s,
 5 2H), 3.83 (s, 3H), 3.49 - 3.25 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.87 (t, J = 7.8Hz, 2H),
 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz,
 3H)。

実施例 2 (125)

- 10 8 - (N-プロピル-N- (テトラヒドロフラン-2-イル) メチルアミノ) - 2-メチル- 3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

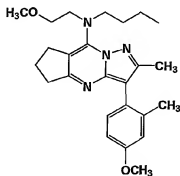


TLC : Rf 0.31 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.84 - 4.06 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.64 - 3.80 (m, 3H), 3.50 - 3.64 (m, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.74 - 2.00 (m, 3H), 1.42 - 1.65 (m, 3H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (1 2 6)

8 - (N - プチル - N - (2 - メトキシエチル) アミノ) - 2 - メチル - 3 -
10 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シク
ロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン



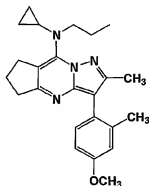
TLC : Rf 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.92 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.57 (m, 2H), 3.50 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

5

実施例 2 (127)

8- (N-プロピル-N-シクロプロピルアミノ) - 2-メチル- 3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ- 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10

TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

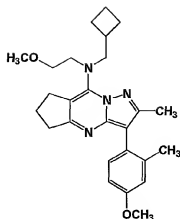
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.19 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.07 (m, 1H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.80 - 0.68 (m, 4H)。

15

実施例 2 (128)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル- 3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ- 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

20

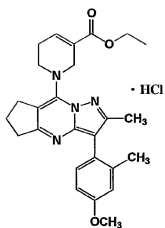


TLC: Rf 0.57 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.82 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.64 (d, J = 7.5Hz, 2H),
 5 3.49 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.62 - 2.50 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 2.06 - 1.58 (m, 6H).

実施例 2 (129)

10 8- (3-エトキシカルボニル-1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

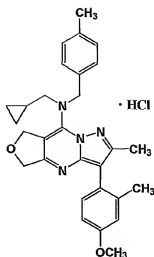


TLC: Rf 0.27 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.27 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.62 (m, 2H), 4.27 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.20 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.16 (t, J = 6.0Hz, 2H), 2.85 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.34 (t, J = 6.9 Hz, 3H).

実施例 2 (130)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

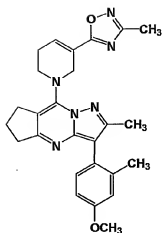


TLC : Rf 0.68 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.21 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.16 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (brs, 2H), 5.27 (m, 2H), 5.22 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m, 1H), 0.67 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

実施例 2 (131)

8 - (3 - (3 - メチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) - 1, 2, 5, 6 - テトラヒドロピリジル) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

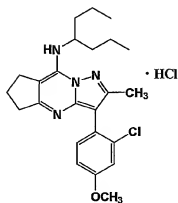


TLC: Rf 0.18 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.29 (m, 1H), 7.15 (d, J= 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.57 (m, 2H), 3.94 (m, 2H), 3.82 (s, 3H),
 5 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.71 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.14 (m, 2H).

実施例 2 (132)

8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

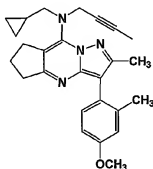


TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.37 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J=2.4, 8.7Hz, 1H), 4.13 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.66 (m, 2H), 3.13 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.60 - 1.84 (m, 4H), 1.34 - 1.60 (m, 4H),
 5 1.00 (t, J=7.2Hz, 3H), 0.99 (t, J=7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (133)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-ブチリル) アミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5
 10 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



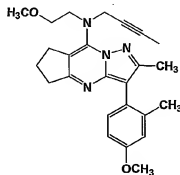
TLC : Rf 0.73 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J=8.1, 2.7Hz, 1H), 4.54 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.53 (d, J=6.9Hz, 2H), 3.13 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J=7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 1.81 (t, J=2.7Hz, 3H), 1.20 - 1.16 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.36 - 0.28 (m, 2H)。

実施例 2 (134)

20 8- (N- (2-メトキシエチル) -N- (2-ブチリル) アミノ) -2-

メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

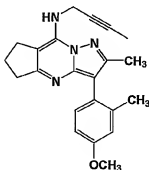


TLC: Rf 0.13 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

- 5 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.15 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 4.44-4.39 (m, 2H), 3.92 (t, J=6.0Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, J=6.0Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 3.13 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J=7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17-2.08 (m, 2H), 1.81 (t, J=2.7Hz, 3H).

10 実施例 2 (135)

8-(2-ブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



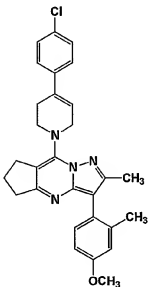
- 15 TLC: Rf 0.80 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.53 (t, J = 6.9Hz, 1H), 4.36 - 4.30 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.25 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.08 (m, 2H), 1.83 (t, J = 2.1Hz, 3H).

5

実施例 2 (136)

8-(4-(4-クロロフェニル)-1,2,5,6-テトラヒドロピリジ
ル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-
ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

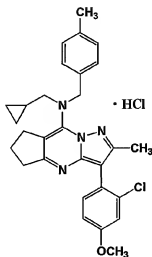
TLC: Rf 0.10 (ヘキサン:酢酸エチル = 3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.22 - 6.18 (m, 1H), 4.50 - 4.32 (m, 2H), 4.10 - 3.90 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.10 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H),

15 2.82 - 2.69 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H).

実施例 2 (137)

8- (N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



5

TLC: Rf 0.53 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

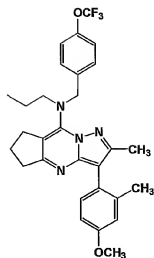
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.36 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.18 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.15 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (d, J=15.9Hz, 1H), 5.21 (d, J=15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.36 - 3.62 (m, 2H), 3.07 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.23 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H).

10

実施例 2 (138)

8- (N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

15

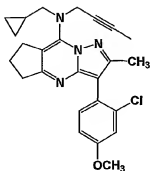


T L C : R f 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H),
 7.15 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.84
 5 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 - 3.35 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.83 (t, J = 7.8Hz,
 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.19 - 2.00 (m, 2H), 1.66 - 1.54 (m, 2H), 0.88 (t, J =
 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (1 3 9)

- 10 8 - (N - (2 - プチリル) - N - シクロプロピルメチルアミノ) - 2 - メ
 チル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5
 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン

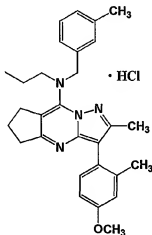


TLC: Rf 0.40 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.54 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.52 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.16 - 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.32 - 0.26 (m, 2H)。

実施例 2 (140)

8 - (N-プロピル-N-(3-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペント[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

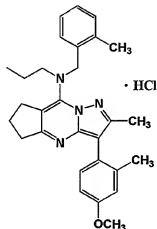


TLC: Rf 0.52 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.27 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.05 (m, 2H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.49 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.02 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (141)

8 - (N-プロピル-N-(2-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



5

TLC: Rf 0.52 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

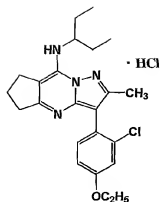
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.18 - 7.30 (m, 4H), 7.13 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J=2.4, 8.1Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.49 (t, J=6.9Hz, 2H), 3.00 (t, J=6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.79 (m, 2H), 0.94 (t, J=7.2Hz, 3H)。

10

実施例 2 (142)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシフェニル) - 6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

15

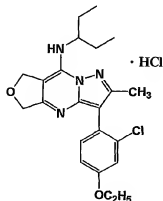


TLC : R f 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.07 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 3.34 - 3.65 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.62 - 1.93 (m, 4H), 1.42 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (143)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-エトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



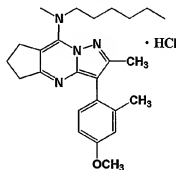
TLC : R f 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.49 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.28 (brs, 2H), 4.07 (m, 2H), 3.40 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98 (m, 4H), 1.43 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

5

実施例 2 (1 4 4)

8 - (N - メチル - N - ヘキシルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン・塩酸塩



10

T L C : R f 0.09 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

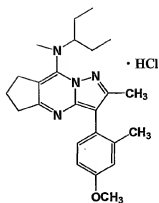
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.01 - 3.95 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.51 - 3.42 (m, 2H), 3.18 - 3.06 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.26 - 2.18 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.96 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.25 (m, 6H), 0.90 (brt, J = 6.6Hz, 3H)。

15

実施例 2 (1 4 5)

8 - (N - メチル - N - (3 - ベンチル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン・塩酸塩

20

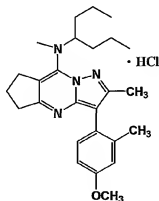


TLC: Rf 0.47 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.46 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.10 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.45 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.76 - 1.98 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (146)

8 - (N-メチル-N-(4-ヘプチル) アミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



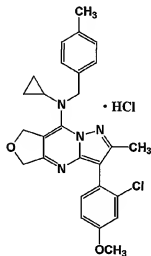
TLC: Rf 0.51 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.80 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.64 - 1.94 (m, 4H), 1.28 - 1.58 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 6H).

5

実施例 2 (147)

8- (N-シクロプロピル-N-(4-メチルフェニル) メチルアミノ) -
2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒド
ロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



10

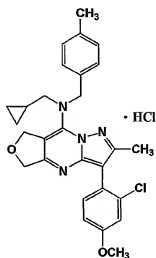
TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.18 - 5.30 (m, 4H), 5.15 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.67 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 0.85 - 1.00 (m, 4H).

15

実施例 2 (148)

8- (N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

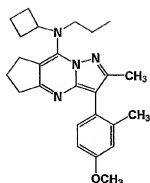


- 5 TLC: R_f 0.58 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1);
 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.19 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.17 (d, J=8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J=2.7, 8.4Hz, 1H), 5.10 - 5.50 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.22 (m, 2H)。

10

実施例 2 (149)

8- (N-シクロプロピル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

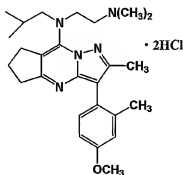


TLC: Rf 0.45 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.17 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J=8.1, 2.7Hz, 1H), 4.35 (quint, J=7.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.69 - 3.10 (m, 2H), 2.94 (t, J=6.9Hz, 2H), 2.90 (t, J=7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 - 2.02 (m, 9H), 1.78 - 1.58 (m, 2H), 1.39 (sext, J=7.8Hz, 2H), 0.84 (t, J=7.8Hz, 3H).

実施例 2 (150)

8-(N-イソブチル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・2塩酸塩



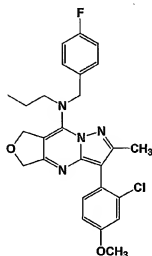
TLC: Rf 0.63 (酢酸エチル:酢酸:水=3:1:1);

NMR(300MHz, DMSO-d₆): δ 7.11 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.91 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 4.08 - 3.98 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.50 - 3.42 (m, 2H),

3.42 - 3.32 (m, 2H), 3.01 (brt, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 2.87 (brt, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 2.79 (s, 3H),
2.77 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 1.80 - 1.64 (m, 1H), 0.83
(d, $J = 6.6\text{Hz}$, 6H).

5 実施例 2 (151)

8 - (N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2 -
メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ
フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



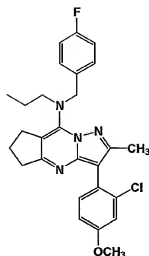
- 10 TLC: Rf 0.34 (ヘキサン:酢酸エチル = 3:1);
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.31 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H), 7.28 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d, $J = 3.0\text{Hz}$, 1H), 7.05 - 6.97 (m, 2H), 6.90 (dd, $J = 8.7, 3.0\text{Hz}$, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.33 - 3.27 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.63 (sext, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 0.39 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 3H).

15

実施例 2 (152)

8 - (N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2 -
メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ

5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

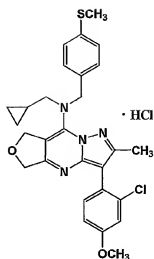


TLC: R_f 0.36 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.28-7.20 (m, 2H), 7.07 (d, J=2.7Hz, 1H), 7.02-6.94 (m, 2H), 6.89 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 (brt, J=7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.82 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (quint, J=7.5Hz, 2H), 1.68-1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J=7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (153)

10 8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

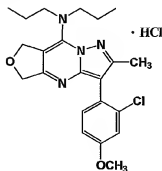


T L C : R f 0.67 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.37 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.33 (d, J = 15.9Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.24 (d, J = 15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例 2 (154)

10 8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

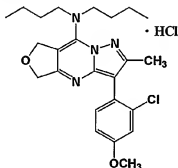


TLC: Rf 0.69 (ヘキサン:酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.48 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H), 5.36 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H), 5.21 (t, J = 1.8Hz, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (155)

8 - (N, N-ジブチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



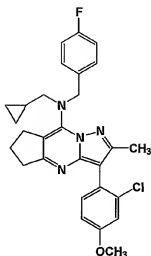
TLC: Rf 0.74 (ヘキサン:酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.47 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.88 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.79 (m, 4H), 1.42 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (156)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7

ージヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

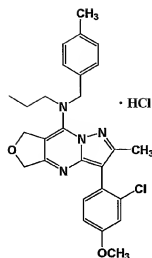


TLC: Rf 0.27 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.33 - 7.26 (m, 3H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.01 -
 5 6.95 (m, 2H), 6.88 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J =
 6.9Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.10 (quint,
 J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.49 - 0.42 (m, 2H), 0.08 - 0.02 (m, 2H)。

実施例 2 (157)

10 8-(N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メ
 チル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フ
 ロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

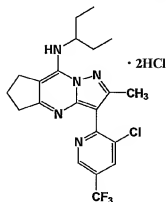


TLC : Rf 0.43 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.28 (m, 2H), 5.13 (m, 2H), 5.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (158)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・2塩酸塩



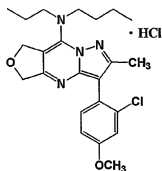
TLC : R f 0.19 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 8.91 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.32 (m, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.06 (brt, J = 6.9Hz, 6H)。

5

実施例 2 (159)

8- (N-ブチル-N-プロピルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : R f 0.21 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

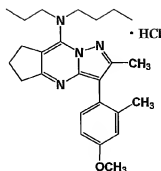
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.47 and 5.35 (ABd, J = 16.5Hz, 2H), 5.21 (brs, 2H), 4.00 - 3.75 (m) and 3.85 (s) total 7H, 2.34 (s, 3H), 1.90 - 1.75 (m, 4H), 1.42 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 1.05 - 0.98 (m, 6H)。

15

実施例 2 (160)

8- (N-ブチル-N-プロピルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

20

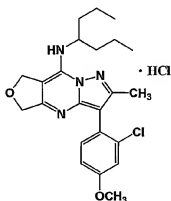


TLC: Rf 0.33 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.95 - 3.80 (m) and 3.83 (s) total 7H, 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.30 - 2.18 (m) and 2.27 (s) total 5H, 2.19 (s, 3H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.38 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 6H).

実施例 2 (161)

8 - (4-ヘプチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



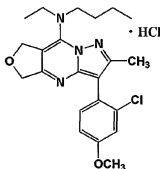
TLC: Rf 0.54 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.52 (d, J = 10.2Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08

(d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.97 (dd, $J = 2.4, 8.7\text{Hz}$, 1H), 5.49 (brd. $J = 16.8\text{Hz}$, 1H), 5.39 (d, $J = 16.8\text{Hz}$, 1H), 5.28 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.53 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 1.75 (m, 4H), 1.47 (m, 4H), 1.00 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H)。

5 実施例 2 (162)

8- (N-ブチル-N-エチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



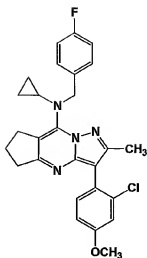
10 T L C : R f 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl_3) : δ 7.33 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H), 7.08 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.96 (dd, $J = 2.4, 8.7\text{Hz}$, 1H), 5.46 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 5.23 (t, $J = 1.5\text{Hz}$, 2H), 3.80 - 4.00 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 1.46 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.44 (m, 2H), 1.01 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H)。

15

実施例 2 (163)

8- (N-シクロプロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

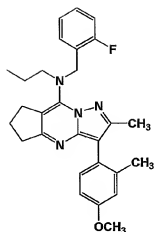


TLC: Rf 0.80 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.17-7.09 (m, 2H), 7.07 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.96-6.93 (m, 2H), 6.90 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.97-2.86 (m, 4H), 2.75 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.03 (m, 2H), 0.80-0.68 (m, 4H).

実施例 2 (164)

8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-
 10 メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ
 5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

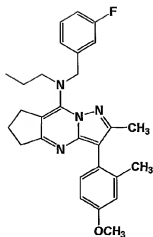


TLC: Rf 0.85 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.24 - 7.12 (m, 2H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 - 6.97 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.00 - 4.92 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.75 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.02 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.46 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (165)

- 10 8 - (N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2-
メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-
5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

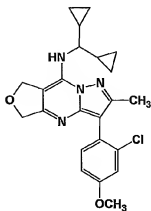


TLC : Rf 0.86 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 - 7.01 (m, 2H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.52 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (166)

- 10 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



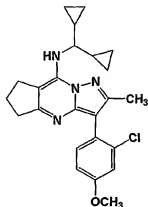
TLC : Rf 0.39 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 6.48 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 5.22 (brs, 2H), 4.89 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.87 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 1.15 (m, 2H), 0.61 (m, 4H), 0.42 (m, 4H)。

5

実施例 2 (167)

8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

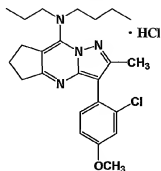
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 6.37 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.14 (m, 2H), 0.50 - 0.66 (m, 4H), 0.35 - 0.50 (m, 4H)。

15

実施例 2 (168)

8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]

ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



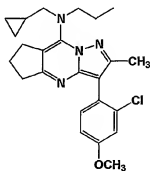
TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 1H),

- 5 4.00 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.10 - 2.95 (m, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.43 - 1.30 (m, 2H), 0.97 (t, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例 2 (169)

- 10 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3-
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シク
ロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

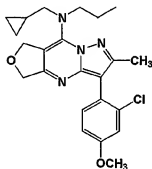
- 15 NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88

(dd, $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.64 - 3.58 (m, 2H), 3.53 (d, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 3.01 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.92 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 1.65 - 1.55 (m, 2H), 1.05 - 0.90 (m, 1H), 0.91 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 0.50 - 0.40 (m, 2H), 0.15 - 0.05 (m, 2H)。

5

実施例 2 (170)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10

TLC: Rf 0.42 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

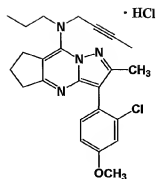
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.30 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 7.07 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.89 (dd, $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 2.38 (s, 3H), 1.63 (quint, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.94 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H),

15 0.56 - 0.46 (m, 2H), 0.15 (dd, $J = 10.8, 5.1\text{Hz}$, 2H)。

実施例 2 (171)

8 - (N-(2-ブチニル)-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

20

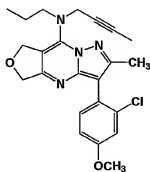


TLC: Rf 0.44 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.96 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 4.56 (d, J = 2.1Hz, 2H), 4.05 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 5H,
 5 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.25 - 3.10 (m, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.95 - 1.80 (m) and 1.89 (s) total 5H, 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (172)

8-(N-(2-ブチル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



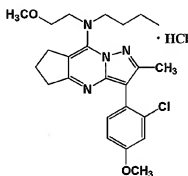
TLC: Rf 0.36 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.28 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.45 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.84 (s,

3H), 3.55 - 3.45 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.72 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (173)

- 5 8 - (N-ブチル-N-(2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

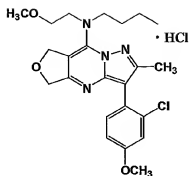


TLC: Rf 0.34 (ヘキサン:酢酸エチル = 2:1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97 (brd, J = 7.8Hz, 1H), 4.30 - 4.18 (m, 2H), 3.90 - 3.78 (m) and 3.85 (s) total 5H, 3.70 - 3.30 (m) and 3.64 (m) total 4H, 3.30 (s, 3H), 3.08 - 2.98 (m, 2H), 2.40 - 2.18 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 2H), 1.43 - 1.35 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15 実施例 2 (174)

- 8 - (N-ブチル-N-(2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

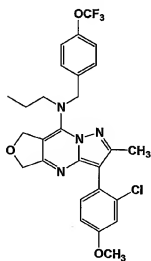


TLC: Rf 0.39 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (brs, 1H), 7.05 - 6.95 (m, 1H), 5.60 - 5.35 (m, 2H), 5.30 - 5.15 (m, 2H), 4.40 - 4.20 (m, 2H), 3.90 - 3.70 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.35 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.85 - 1.70 (m, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 0.99 (t, J = 6.9Hz, 3H).

実施例 2 (175)

8 - (N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチロキシフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

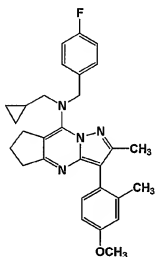


TLC: Rf 0.42 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.39 - 7.33 (m, 2H), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.21 - 7.15 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 - 3.28 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.54 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (176)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

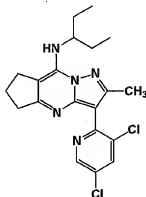


TLC: Rf 0.28 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.33 - 7.26 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.03 - 6.94 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.95 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 6.9Hz, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.58 - 0.42 (m, 2H), 0.20 - 0.01 (m, 2H)。

実施例 2 (177)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



5

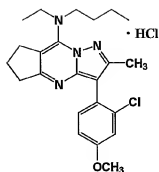
TLC: Rf 0.38 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 8.58 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.81 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.24 (brd, J=11.1Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J=7.5Hz, 2H), 1.80-1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J=7.5Hz, 6H).

10

実施例 2 (178)

8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

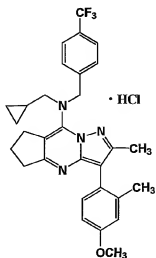


TLC: Rf 0.61 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J=2.7, 8.4Hz, 1H), 3.94 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.30 - 3.62 (m, 2H), 3.05 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.32 - 1.48 (m, 5H), 0.98 (t, J=7.8Hz, 3H)。

実施例 2 (179)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)
 10 メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-
 -6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピ
 リミジン・塩酸塩

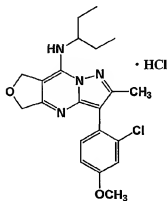


TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.65 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (m, 2H), 3.52 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.14 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.17 (m, 2H)

実施例 2 (180)

8- (3-ベンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



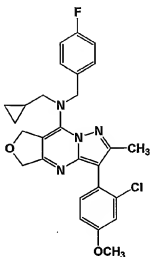
TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.50 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.39 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98 (m, 4H), 1.06 (m, 6H).

実施例 2 (181)

8- (N-シクロプロピルメチルアミノ-N- (4-フルオロフェニル) メ

チルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) -
5, 7 - ジヒドロ - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

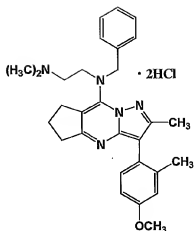


TLC : Rf 0.28 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

- 5 NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 - 7.28 (m, 2H), 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.901 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 2.40 (s, 3 H), 1.08 - 0.94 (m, 1H), 0.56 - 0.48 (m, 2H), 0.14 - 0.06 (m, 2H).

10 実施例 2 (182)

8 - (N - ベンジル - N - (2 - ジメチルアミノエチル) アミノ) - 2 - メ
チル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5
H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・2 塩酸塩

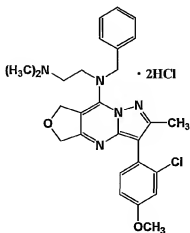


TLC : Rf 0.60 (酢酸エチル : 酢酸 : 水 = 3 : 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CD₃OD): δ 7.45 - 7.32 (m, 5H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.40 (m, 2H), 3.84 (s, 3H),
 5 3.75 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 3.06 (m, 2H), 2.96 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 2.38 - 2.18 (m, 2H), 2.11 (s, 3H)。

実施例 2 (183)

8 - (N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メ
 10 チル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフ
 ロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・2塩酸塩



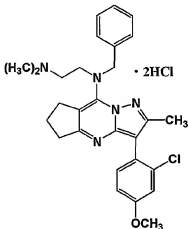
TLC: Rf 0.80 (酢酸エチル: 酢酸: 水 = 3 : 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CD₃OD) : δ 7.60 - 7.30 (m, 6H), 7.19 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 4.40 - 4.24 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 (m, 1H), 3.56 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.44 (s, 3H).

5

実施例 2 (184)

8 - (N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・2塩酸塩



10

TLC: Rf 0.27 (クロロホルム: メタノール = 9 : 1) ;

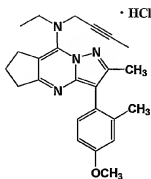
NMR(300MHz, CD₃OD) : δ 7.46 - 7.26 (m, 6H), 7.20 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.34 - 4.20 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 - 3.64 (m, 2H), 3.34 - 2.86 (m) and 2.96 (s) total 10H, 2.41 (s, 3H), 2.26 - 2.10 (m, 2H).

15

実施例 2 (185)

8 - (N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン

タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



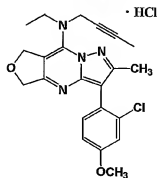
TLC: Rf 0.36 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

- 5 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.55 (q, J = 2.1Hz, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.90 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (186)

- 10 8-(N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

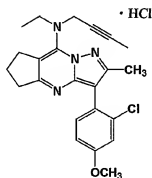


TLC: Rf 0.26 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 5.36 (m, 2H), 4.46 (m, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.89 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.51 (t, J = 7.2Hz, 3H).

5 実施例 2 (187)

8 - (N - (2 - ブチニル) - N - エチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩

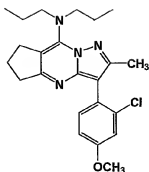


- 10 TLC: Rf 0.32 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;
 NMR(300Hz, CDCl₃): δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.54 (m, 2H), 4.09 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.64 (m, 2H), 3.22 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.90 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H).

15

実施例 2 (188)

8 - (N, N - ジブチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

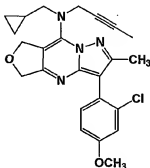


T L C : R f 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.58 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (1 8 9)

8 - (N - (2 - ブチニル) - N - シクロプロピルメチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 , 7 - ジヒドロ - フ
10 ロ [3 , 4 - d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン



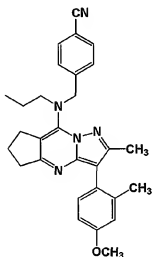
T L C : R f 0.50 (トルエン : アセトン = 5 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.56 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.64 - 0.56 (m, 2H), 0.38

- 0.28 (m, 2H),

実施例 2 (190)

8 - (N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ) - 2-メ
 5 チル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5
 H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

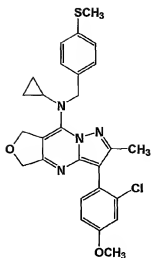


TLC: Rf 0.22 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.60 (brd, J=8.1Hz, 2H), 7.47 (brd, J=8.1Hz, 2H),
 10 7.17 (d, J=8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J=8.7, 2.7Hz, 1H), 4.90
 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.94 - 2.82 (m, 4H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H),
 2.11 (m, 2H), 1.59 (m, 2H), 0.88 (t, J=7.2Hz, 3H).

実施例 2 (191)

15 8 - (N-シクロプロピル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)
 - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒ
 ドロ-6H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

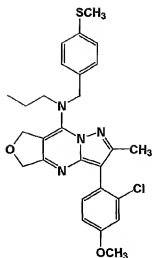


TLC: Rf 0.20 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.19-7.13 (m, 2H), 7.08 (d, J=2.7Hz, 1H), 7.06-7.01 (m, 2H), 6.91 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 0.95-0.88 (m, 4H)。

実施例2 (192)

8-(N-プロピル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-
 10-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ
 -プロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

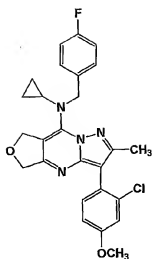


TLC : Rf 0.25 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H),
 5 3.84 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (193)

8 - (N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)
 10 - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

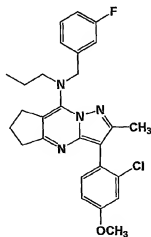


TLC: R_f 0.19 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.14 - 7.04 (m, 3H), 7.02 - 6.94 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 4.91 (s, 2H),
 5 3.84 (s, 3H), 2.55 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.90 - 0.76 (m, 4H).

実施例 2 (194)

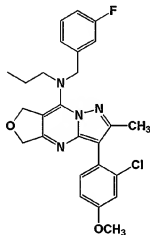
8 - (N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2 -
 メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ
 10 5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



TLC: Rf 0.48 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;
 NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 2H) 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.77 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.04
 5 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.63 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (195)

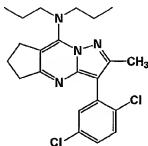
8 - (N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-
 メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ
 10 フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



TLC: Rf 0.46 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;
 NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.28 - 7.16 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.07 - 6.99 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.04 (s,
 15 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.13 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.68 (sext, J = 7.5Hz, 2H),
 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (196)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2,5-ジクロロフェニル)-
6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリ
ミジン

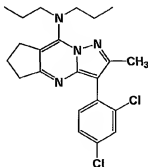


- 5 T L C : R f 0.64 (ヘキサン：酢酸エチル＝3：1) ；
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.41 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.23
(dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.8Hz) and 2.93 (t, J =
7.8Hz) total 4H, 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.65 - 1.50 (m, 4H), 0.89 (t,
J = 7.2Hz, 6H)。

10

実施例 2 (197)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2,4-ジクロロフェニル)-
6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリ
ミジン



15

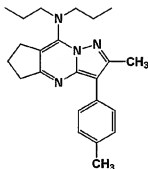
T L C : R f 0.57 (ヘキサン：酢酸エチル＝3：1) ；

NMR (300MHz, CDCl_3): δ 7.51 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 7.35 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 7.29 (dd, $J = 8.1, 2.4\text{Hz}$, 1H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 2.96 (t, $J = 7.2\text{Hz}$) and 2.92 (t, $J = 7.2\text{Hz}$) total 4H, 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 0.89 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H).

5

実施例 2 (198)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

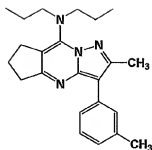


10 TLC: Rf 0.58 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR (300MHz, CDCl_3): δ 7.58 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 7.24 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 3.00 - 2.90 (m, 4H), 2.56 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.14 (quint, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 1.64 - 1.48 (m, 4H), 0.87 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H).

15 実施例 2 (199)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

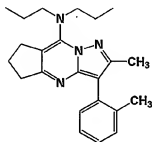


TLC: Rf 0.61 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.50 (s) and 7.47 (d, J=7.5Hz) total 2H, 7.32 (t, J=7.5Hz, 1H), 7.06 (t, J=7.5Hz, 1H), 3.60-3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J=7.8Hz, 4H), 2.57 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J=7.8Hz, 2H), 1.64-1.45 (m, 4H), 0.88 (t, J=7.2Hz, 6H).

実施例 2 (200)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

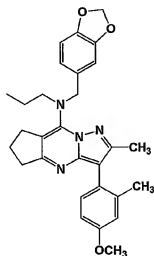


TLC: Rf 0.56 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35-7.20 (m, 4H), 3.62-3.54 (m, 4H), 2.96 (t, J=7.2Hz) and 2.90 (t, J=7.2Hz) total 4H, 2.34 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.13 (quint, J=7.2Hz, 2H), 1.63-1.50 (m, 4H), 0.89 (t, J=7.5Hz, 6H).

実施例 2 (201)

8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d][1,3-ジオキソラン-5-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



5

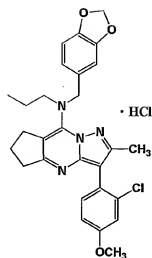
TLC: Rf 0.31 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);
 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.18 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.77 - 6.83 (m, 2H), 6.67 - 6.75 (m, 2H), 5.94 (s, 2H), 4.74 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m, 2H), 2.89 (t, J=7.8Hz, 2H), 2.85 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.08 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.88 (t, J=7.2Hz, 3H).

10

実施例2 (202)

8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d][1,3-ジオキソラン-5-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

15

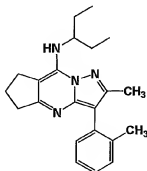


TLC: Rf 0.38 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.36 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.70 - 6.82 (m, 3H), 6.00 (s, 2H), 5.07 (s, 2H), 3.85 (s, 3H),
 5 3.71 (m, 2H), 3.36 - 3.64 (m, 2H), 3.03 (t, J = 7.4Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.24 (m, 2H),
 1.74 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (203)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル - 3 - (2-メチルフェニル) -
 10 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリ
 ミジン



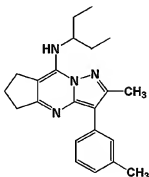
TLC: Rf 0.39 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.30 - 7.18 (m, 4H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.90 - 3.75 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.58 (m, 4H), 1.08 - 0.96 (m, 6H).

5

実施例 2 (204)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-
6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリ
ミジン



10

TLC: Rf 0.45 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

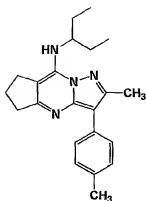
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.50 (s, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.86 - 3.74 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

15

実施例 2 (205)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-
6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリ
ミジン

20

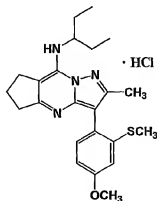


TLC : R f 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

¹H NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.57 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.24 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.20 (10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H).

実施例 2 (206)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル - 3 - (2-メチルチオ - 4-メ
10 トキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ - 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ
[1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

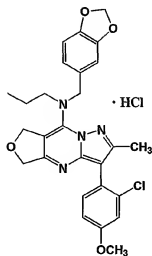


TLC : R f 0.10 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.26 - 7.16 (m, 1H), 6.83 (m, 1H), 6.84 - 6.76 (m, 1H), 3.97 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.95 - 1.44 (m, 4H), 1.11 - 0.99 (m, 6H)。

5 実施例 2 (207)

8- (N-プロピル-N- (ベンゾ [d] 1, 3-ジオキソラン-5-イル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

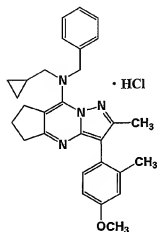
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 6.78 - 6.83 (m, 2H), 6.72 (m, 1H), 5.99 (s, 2H), 5.28 (m, 2H), 5.16 (s, 2H), 5.04 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15

実施例 2 (208)

8- (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) -2-メチル-3-

— (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

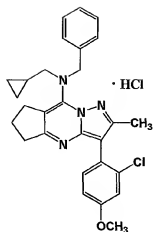


TLC: Rf 0.58 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.25 - 7.43 (m, 5H), 7.13 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 7.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 3.48 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.16 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H).

10 実施例 2 (209)

8- (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

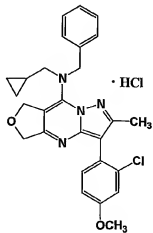


TLC : Rf 0.56 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.25 - 7.43 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.27 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.68 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.07 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.16 (m, 1H), 0.64 (m, 2H), 0.18 (m, 2H)。

実施例 2 (210)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3
10 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ [3,
4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



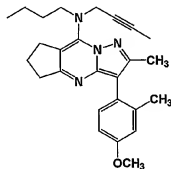
TLC: Rf 0.47 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.26 - 7.45 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.36 (m, 2H), 5.28 (m, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.66 (m, 2H), 0.22 (m, 2H).

5

実施例 2 (211)

8- (N-ブチル-N- (2-ブチニル) アミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10

TLC: Rf 0.38 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

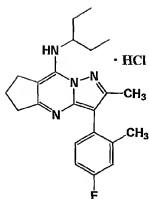
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.40 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.63 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H).

15

実施例 2 (212)

8- (3-ベンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-フルオロフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

20



TLC: Rf 0.44 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

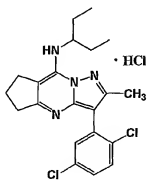
NMR (300MHz, DMSO-d₆): δ 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 4.03 - 3.85 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.95 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.25 - 2.10

5 (m) and 2.12 (s) total 5H, 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.95 - 0.85 (m, 6H)。

実施例 2 (213)

8- (3-ベンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2, 5-ジクロロフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a]

10 ピリミジン・塩酸塩



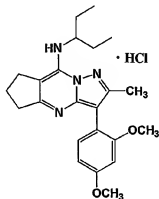
TLC: Rf 0.46 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, DMSO-d₆): δ 7.68 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.62 - 7.55 (m) and 7.59 (s) total 2H, 4.03 - 3.85 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.96 (brt, J = 7.8Hz, 2H),

2.32 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H)。

実施例 2 (214)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2, 4-ジメトキシフェ
5 ニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-
a] ピリミジン・塩酸塩

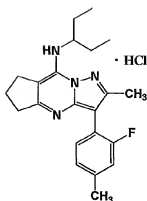


TLC : Rf 0.43 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, DMSO- d_6) : δ 7.24 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 6.71 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H),
10 6.66 (dd, $J = 8.1, 2.4\text{Hz}$, 1H), 4.05 - 3.85 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.15 (brt,
 $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 2.99 (brt, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 -
1.63 (m, 4H), 0.89 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H)。

実施例 2 (215)

15 8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-フルオロ-4-メチ
ルフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,
5-a] ピリミジン・塩酸塩

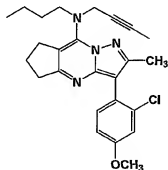


TLC: Rf 0.43 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, DMSO-d₆): δ 9.20-9.00 (m, 1H), 7.39 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.22 (d, J = 11.1Hz, 1H), 7.17 (d, J = 7.8Hz, 1H), 4.05 - 3.60 (m, 1H, covered with H₂O in DMSO-d₆), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.83 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (2 1 6)

8 - (N - プチル - N - (2 - プチニル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - ククロ - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン



TLC: Rf 0.80 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

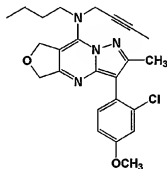
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88

(dd, $J = 8.7, 2.4\text{Hz}$, 1H), 4.39 (q, $J = 2.1\text{Hz}$, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 2.93 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 1.81 (t, $J = 2.1\text{Hz}$, 3H), 1.68 - 1.54 (m, 2H), 1.39 (sext, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 0.94 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H).

5

実施例 2 (217)

8- (N-ブチル-N- (2-ブチニル) アミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10

TLC: Rf 0.78 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

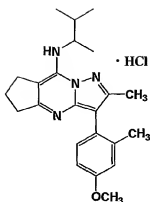
NMR (300MHz, CDCl_3) : δ 7.28 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 1H), 7.07 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.89 (dd, $J = 8.7, 2.7\text{Hz}$, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.44 (q, $J = 2.4\text{Hz}$, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, $J = 2.4\text{Hz}$, 3H), 1.74 - 1.61 (m, 2H), 1.41 (sext, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 0.96 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H).

15

実施例 2 (218)

8- (3-メチル-2-ブチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

20

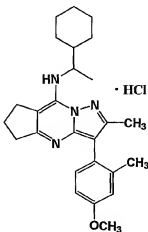


TLC : R f 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.45 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.11 (dd J = 4.2, 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.99 (m, 1H), 1.42 and 1.41 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.05 - 1.14 (m, 6H)。

実施例 2 (2 1 9)

8 - (1 - シクロヘキシルエチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル
10 - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d]
ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ・ 塩酸塩

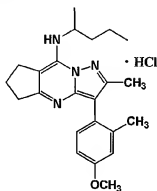


TLC: Rf 0.36 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.42 (brd, J = 10.5Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.1Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.28 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.18 (s, total 3H), 1.52 - 1.95 (m, 6H), 1.41 and 1.40 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 - 1.37 (m, 5H).

実施例 2 (220)

8-(2-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

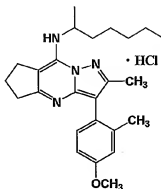


TLC: Rf 0.36 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.34 (brd, J = 9.6Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.25 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.16 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.70 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.58 (m, 2H), 1.47 and 1.46 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 (m, 3H).

20 実施例 2 (221)

8-(2-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

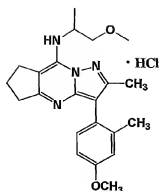


- 5 TLC: R_f 0.43 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);
 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.4Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.71 - 1.81 (m, 2H), 1.30 - 1.55 (m, 9H), 0.92 (m, 3H)。

10

実施例 2 (222)

8-(1-メトキシ-2-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

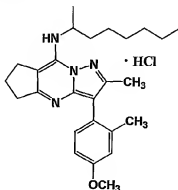


TLC: Rf 0.30 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.66 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.46 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.64 (dd, J = 3.9, 9.9Hz, 1H), 3.42 - 3.58 (m, 3H), 3.46 and 3.45 (s, total 3H), 3.23 (m, 1H), 3.11 (m, 1H), 2.29 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.19 and 2.18 (s, total, 3H), 1.49 (d, J = 6.6Hz, 3H).

実施例 2 (223)

- 10 8-(2-オクチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

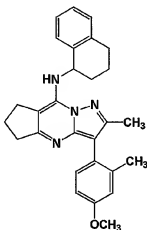


TLC: Rf 0.60 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 7.33 (brd, $J = 10.2\text{Hz}$, 1H), 7.12 and 7.11 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, total 1H), 6.89 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.82 (dd, $J = 2.7, 8.1\text{Hz}$, 1H), 4.23 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (brt, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.15 (t, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.75 (m, 2H), 1.46 and 1.45 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, total 3H),
 5 1.26 - 1.45 (m, 8H), 0.90 (m, 3H)。

実施例 2 (2 2 4)

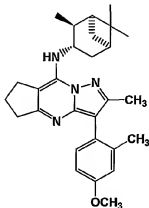
8 - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) アミノ - 2 -
 メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ -
 10 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン



T L C : R f 0.16 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;
 NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 7.44 (m, 1H), 7.27 - 7.14 (m, 4H), 6.85 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.78 (dd, $J = 8.1, 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.69 (brd, $J = 9.9\text{Hz}$, 1H), 5.22 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.24 - 3.08 (m, 2H), 3.00 - 2.76 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 2.24 - 1.82 (m, 6H), 2.20 (s, 3H)。

実施例 2 (2 2 5)

8-((1S, 2S, 3S, 5R)-2, 6, 6-トリメチルビシクロ[3.1.1]-3-ヘプチル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



5

TLC: R_f 0.25 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

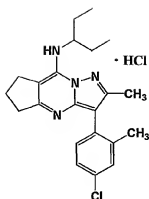
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.16 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J=8.1, 2.4Hz, 1H), 6.35 (brd, J=10.8Hz, 1H), 4.31 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.22 - 3.06 (m, 2H), 2.91 (t, J=8.1Hz, 2H), 2.62 - 2.46 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.19 - 1.82 (m, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.20 (d, J=6.0Hz, 3H), 1.11 - 1.08 (m, 1H), 1.09 (s, 3H)。

10

実施例 2 (226)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-クロロフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

15



TLC : Rf 0.41 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

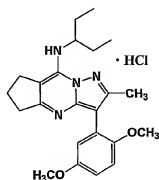
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.26 - 7.10 (m, 2H), 4.04 - 3.90 (m, 1H), 3.60 - 3.30 (m, 2H), 3.13 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28

5 (quint, J = 6.6Hz, 2H), 1.92 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (2 2 7)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 , 5 - ジメトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1 , 5 -

10 a] ピリミジン・塩酸塩



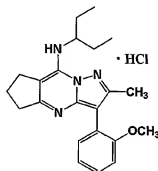
TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 - 7.24 (m, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 2H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 4.05 - 3.95 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.8Hz, 2H),

3.12 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.29 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例 2 (228)

- 5 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

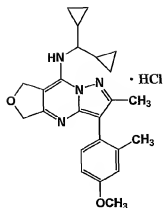


TLC: Rf 0.24 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.41 (t, J = 8.1Hz, 1H), 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.10 - 7.02 (m, 2H), 4.03 - 3.90 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.36 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

15 実施例 2 (229)

8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

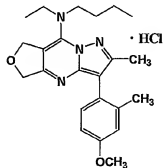


TLC : Rf 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.87 (m, 1H), 7.11 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.19 (m, 2H), 3.83 (s, 3H),
 2.90 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.26 (m, 2H), 0.66 - 0.85 (m, 4H), 0.47 (m, 4H)。

実施例 2 (230)

8 - (N-ブチル-N-エチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-
 4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ
 [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



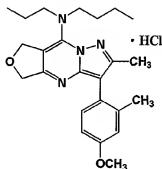
TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.10 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

(dd, $J = 2.7, 8.7\text{Hz}$, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.85 - 4.00 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 2H), 1.46 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 3H), 1.44 (m, 2H), 1.02 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 3H)。

5 実施例 2 (231)

8 - (N-ブチル-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ [1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



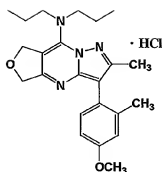
10 TLC: Rf 0.54 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl_3): δ 7.10 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 6.89 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.82 (dd, $J = 2.4, 8.4\text{Hz}$, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.87 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 4H), 1.42 (m, 2H), 1.02 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.00 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H)。

15

実施例 2 (232)

8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ [1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



T L C : R f 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl_3) : δ 7.10 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 6.89 (d, $J = 3.0\text{Hz}$, 1H), 6.82

(dd, $J = 3.0, 8.4\text{Hz}$, 1H), 5.39 (brs, 2H), 5.21 (brs, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.83 (s, 3H),

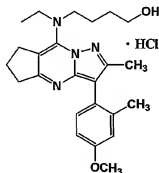
5 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H)。

実施例 2 (233)

8 - (N-エチル-N-(4-ヒドロキシブチル)アミノ)-2-メチル-

3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シ

10 クロペンタ[*d*]ピラゾロ[1,5-*a*]ピリミジン・塩酸塩



T L C : R f 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) ;

NMR (300MHz, CDCl_3) : δ 7.10 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 6.87 (d, $J = 3.0\text{Hz}$, 1H), 6.79

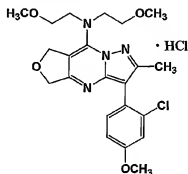
(dd, $J = 3.0, 8.4\text{Hz}$, 1H), 3.87 - 4.01 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, $J = 6.0\text{Hz}$, 2H),

15 3.38 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.06 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s,

3H), 1.86 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 1.38 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H)。

実施例 2 (234)

8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-
5 4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ
[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

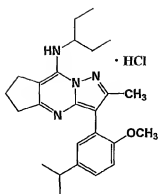


TLC: Rf 0.35 (ヘキサン:酢酸エチル=1:2) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.33 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 7.08 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.96
10 (dd, $J = 2.4, 8.4\text{Hz}$, 1H), 5.40 (m, 1H), 5.33 (m, 1H), 5.25 (m, 2H), 4.15 (m, 4H),
3.85 (s, 3H), 3.71 (t, $J = 5.1\text{Hz}$, 4H), 3.35 (s, 6H), 2.35 (s, 3H)。

実施例 2 (235)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-5-イソ
15 プロピルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾ
ロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

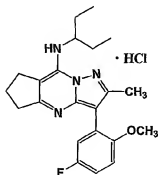


TLC: Rf 0.36 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.23 (dd, J=8.4, 2.1Hz, 1H), 7.12 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.98 (d, J=8.4Hz, 1H), 4.00 - 3.85 (m) and 3.91 (s) total 4H, 3.58 - 3.30 (m, 2H),
 5 3.11 (t, J=6.9Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.35 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.50 (m, 4H), 1.26 (d, J=6.9Hz, 6H), 1.04 (t, J=7.5Hz, 6H)。

実施例 2 (236)

8 - (3-ベンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メトキシ-5-フル
 10 オロフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,
 5-a] ピリミジン・塩酸塩



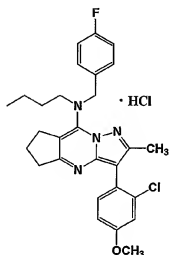
TLC: Rf 0.26 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.20 - 6.95 (m, 4H), 4.04 - 3.80 (m) and 3.91 (s) total

4H, 3.52 - 3.40 (m, 2H), 3.12 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.27 (quint, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H)。

実施例 2 (237)

- 5 8 - (N-ブチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

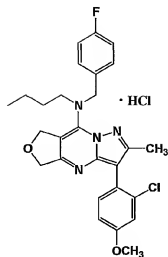


TLC: Rf 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl_3): δ 7.44 - 7.20 (m, 3H), 7.14 - 6.90 (m, 4H), 5.03 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 3.29 (m, 2H), 2.96 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.65 (m, 2H), 1.32 (m, 2H), 0.90 (m, 3H)。

実施例 2 (238)

- 15 8 - (N-ブチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-6H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC: R_f 0.20 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

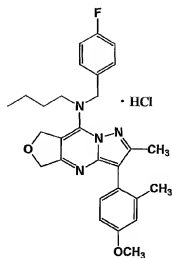
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.40 - 7.26 (m, 3H), 7.12 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d,

J = 2.1Hz, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.40 (m, 2H), 5.30 - 5.08 (m, 4H), 3.85 (s, 3H),

5 3.70 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.76 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (239)

8 - (N-ブチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メ
チル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフ
10 ロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

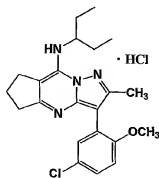


TLC: R_f 0.28 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.29 (m, 2H), 7.18 - 7.04 (m, 3H), 6.89 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.85 - 6.78 (m, 1H), 5.23 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.83 (s, 3H),
 5 3.58 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.71 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.95 - 0.84 (m, 3H)。

実施例 2 (240)

8 - (3-ベンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メトキシ-5-クロ
 10 ロフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,
 5-a] ピリミジン・塩酸塩

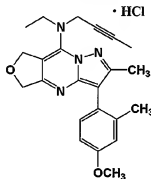


TLC: Rf 0.26 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.33 (dd, J=9.0, 3.0Hz, 1H), 7.25 - 7.05 (m) and 7.22 (d, J=3.0Hz) total 2H, 6.98 (d, J=9.0Hz, 1H), 4.03 - 3.85 (m) and 3.93 (s) total 4H, 3.55 - 3.40 (m, 2H), 3.13 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.28 (quint, J=7.2Hz, 2H),
 5 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J=7.5Hz, 6H).

実施例 2 (241)

8-(N-エチル-N-(2-ブチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]
 10 ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

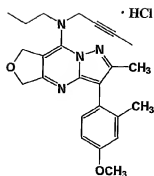


TLC: Rf 0.37 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.10 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J=2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 4H), 4.48 (m, 2H), 4.14 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.90 (t, J=2.4Hz, 3H), 1.54 (t, J=7.2Hz, 3H).

実施例 2 (242)

8-(N-プロピル-N-(2-ブチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]
 20 ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC: Rf 0.47 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

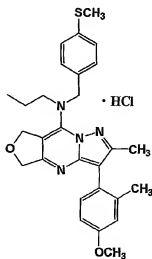
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.10 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.89 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.82

(dd, J=2.7, 8.1Hz, 1H), 5.41 (m, 2H), 5.39 (m, 2H), 5.42 (m, 2H), 3.98 (m, 2H),

5 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.89 (t, J=2.7Hz, 3H), 1.05 (t, J=7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (243)

8-(N-プロピル-N-(4-メチルチオフエニル)メチルアミノ)-2-
10 -メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ
-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

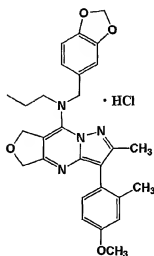


TLC: Rf 0.45 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.11 - 5.26 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.84 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (244)

8- (N-プロピル-N- (ベンゾ [d] 1, 3-ジオキソラン-5-イル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

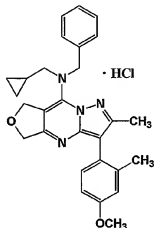


TLC: Rf 0.45 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.5Hz, 1H), 6.78 (d, J = 1.5Hz, 1H), 6.73 (dd, J = 1.5, 7.5Hz, 1H), 6.01 (s, 2H), 5.39 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.81 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (245)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3-
 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-プロ [3,
 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



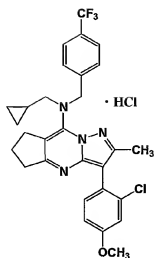
5

TLC: Rf 0.47 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.34 - 7.46 (m, 3H), 7.26 - 7.33 (m, 2H), 7.13 (d, J =
 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 5.33
 (m, 2H), 5.24 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.73 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m,
 10 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

実施例 2 (246)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)
 メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-5-メトキシフェニル)
 15 - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピ
 リミジン・塩酸塩

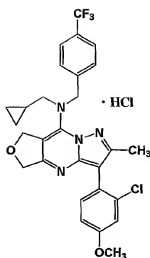


T L C : R f 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.62 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.48 (brd, J = 7.8Hz, 2H),
 7.34 (brd, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.90 - 6.88 (m, 1H), 5.19 (brs, 2H),
 5 3.85 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 3.36 - 3.14 (m, 2H), 3.14 - 2.98 (m, 2H), 2.36 (s, 3H),
 2.22 (m, 2H), 1.12 - 0.98 (m, 1H), 0.64 - 0.52 (m, 2H), 0.18 - 0.08 (m, 2H)。

実施例 2 (247)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)
 10 メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)
 -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン
 ・塩酸塩



TLC: Rf 0.42 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

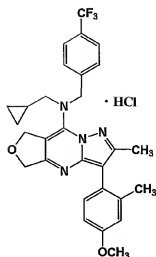
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.65 (brd, J=7.5Hz, 2H), 7.49 (brd, J=7.5Hz, 2H),

7.33 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J=8.4, 2.4Hz, 1H), 5.35 -

5.18 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.54 (d, J=6.6Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.72 -
0.60 (m, 2H), 0.22 - 0.14 (m, 2H)。

実施例 2 (248)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)
10 メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)
-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

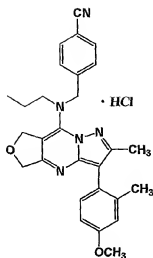


TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.68 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.42 (m, 2H), 5.38 (s, 2H), 5.27 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.74 - 0.66 (m, 2H), 0.26 - 0.18 (m, 2H)。

実施例 2 (249)

8 - (N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.66 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.8Hz, 2H),

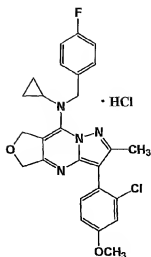
7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.15

5 (brs, 2H), 5.09 (brs, 2H), 5.01 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m, 2H), 2.33 (s, 3H),
2.18 (s, 3H), 1.74 - 1.60 (m, 2H), 0.91 (t, J = 6.9Hz, 3H).

実施例 2 (250)

8 - (N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)

10 - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC: R_f 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 3H), 7.02 -

6.94 (m 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.18 (s, 2H), 4.94 (s, 2H),

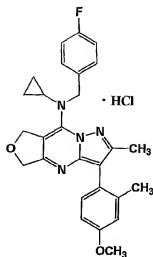
5 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.89 - 0.79 (m, 4H)。

実施例 2 (251)

8 - (N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)

- 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒ

10 ドローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

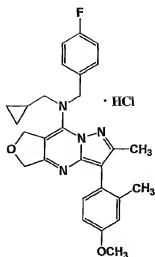


TLC : R_f 0.44 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.19 - 7.08 (m, 3H), 7.04 - 6.96 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.28 - 5.18 (m, 4H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.60 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.90 - 0.80 (m, 4H).

実施例 2 (252)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

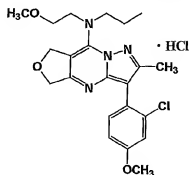


TLC : R_f 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.15 - 7.05 (m, 3H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.32 - 5.20 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.20 - 1.08 (m, 1H), 0.72 - 0.62 (m, 2H), 0.28 - 0.18 (m, 2H)。

実施例 2 (253)

8 - (N-プロピル-N-(2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-
10 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

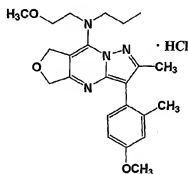


T L C : R f 0.35 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.38 - 4.22 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 - 3.66 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (254)

8 - (N-プロピル-N-(2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-
3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3,
10 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



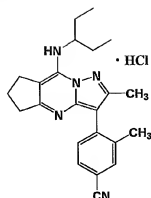
T L C : R f 0.33 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.80 - 3.60 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (255)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-シアノ
20 フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,

5-a] ピリミジン・塩酸塩

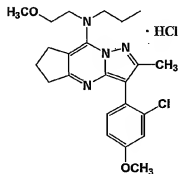


TLC: R_f 0.45 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.65 (s, 1H), 7.57 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.24 - 7.08 (m, 1H), 4.06 - 3.88 (m, 1H), 3.41 (brt, J = 7.2Hz, 2H), 3.15 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.30 (s) total 8H, 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 6.6Hz, 6H)。

実施例 2 (256)

- 10 8-(N-プロピル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



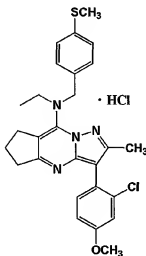
TLC: R_f 0.46 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 7.34 (brd, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 7.08 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.99 - 6.91 (m, 1H), 4.20 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.52 - 3.30 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.03 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 0.96 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H)。

5

実施例 2 (257)

8- (N-エチル-N- (4-メチルチオフエニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

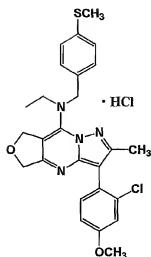
NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.30 - 7.16 (m, 4H), 7.08 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 3.00 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.34 (m, 3H)。

15

実施例 2 (258)

8- (N-エチル-N- (4-メチルチオフエニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-

フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

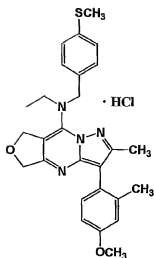


TLC: Rf 0.35 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (brd, J = 8.1Hz, 2H),
 5 7.21 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.48
 - 5.27 (m, 2H), 5.27 - 5.06 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.88 - 3.78 (m, 2H), 2.50 (s, 3H),
 2.36 (s, 3H), 1.42 (t, J = 6.9Hz, 3H).

実施例 2 (259)

10 8-(N-エチル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-
 メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ
 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

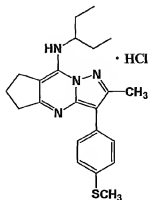


TLC: Rf 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.28 (brd, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (brd, J = 8.4Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H),
 5.40 (brs, 2H), 5.22 - 5.08 (m, 4H), 3.86 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.43 (t, J = 6.6Hz, 3H).

実施例 2 (260)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルチオフェニル)
 10 -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



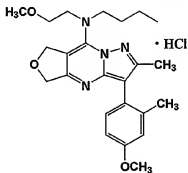
TLC: Rf 0.46 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.52 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.31 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.06 - 3.90 (m, 1H), 3.60 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 2.30 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

5

実施例 2 (261)

8 - (N-ブチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-
 - (2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3,
 10 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC: Rf 0.61 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 2) ;

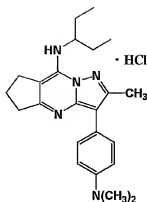
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.29 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.72 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.77 (quintet, J = 7.5Hz, 2H), 1.42 (sixtet, J = 7.5Hz, 2H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

15

実施例 2 (262)

8 - (3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3- (4-ジメチルアミノフェ
 20 ニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-

a] ピリミジン・塩酸塩

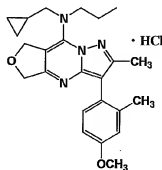


TLC: Rf 0.57 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.72 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.60 - 7.40 (m, 2H), 6.88 - 6.75 (m, 1H), 3.98 - 3.85 (m, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 3.15 - 3.05 (m) and 3.13 (s) total 8H, 2.52 (s, 3H), 2.25 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6H),

実施例 2 (263)

10 8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



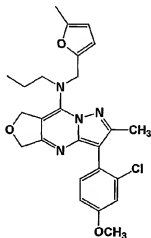
TLC: Rf 0.55 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.69 - 3.63 (m, 4H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.70 (s, J = 7.5Hz, 2H), 1.07 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.56 (m, 2H), 0.20 (m, 2H)。

5

実施例 2 (264)

8- (N-プロピル-N- (5-メチルフラン-2-イル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10

TLC : R_f 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

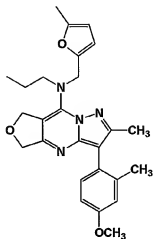
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.02 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.26 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.66 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15

実施例 2 (265)

8- (N-プロピル-N- (5-メチルフラン-2-イル) メチルアミノ)

-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒ
 ドロ-フロン [3,4-d]ピラゾロ [1,5-a]ピリミジン

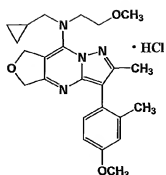


TLC : R_f 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (d, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 6.01 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.25 (m, 2H), 2.3 7 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.67 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H).

10 实施例2 (2 6 6)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -
2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒド
ロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

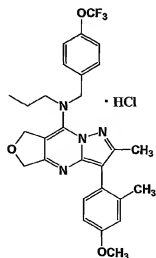


TLC: Rf 0.29 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.05 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.48 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.04 (m, 1H), 0.56 (m, 2H), 0.22 (m, 2H)。

実施例 2 (267)

8 - (N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

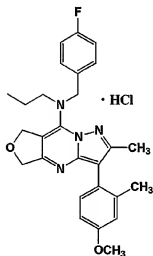


TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.36 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.18 (brd, J = 8.1Hz, 2H),
7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.13
(brs, 2H), 4.97 (brs, 2H), 4.92 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H),
2.18 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (268)

8- (N-プロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-
メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ
10 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

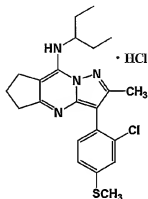


TLC : Rf 0.53 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 - 7.22 (m, 2H), 7.17 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 7.02
(m, 2H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.95 (brs,
15 4H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 0.90 (t, J =
6.9Hz, 3H).

実施例 2 (269)

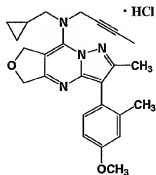
8- (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メチルチオフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



- 5 TLC : Rf 0.64 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;
 NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.40 - 7.34 (m, 2H), 7.33 - 7.24 (m, 2H), 3.99 (m, 1H),
 3.66 - 3.35 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.30 (m, 2H),
 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.10 - 1.00 (m, 6H).

10 実施例 2 (270)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-ブチニル) アミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ [3, 4-d] ピリミジン・塩酸塩



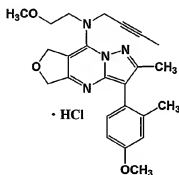
T L C : R f 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.14 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J=8.1, 2.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.84 (s, 3H), 1.20 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

5 2H)。

実施例 2 (2 7 1)

8 - (N - (2 - メトキシエチル) - N - (2 - プチニル) アミノ) - 2 -
メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 5 , 7 - ジヒドロ
10 フロ [3 , 4 - d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ・ 塩酸塩



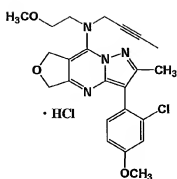
T L C : R f 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.13 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J=8.1, 2.4Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.06 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.85 (s, 3H)。

15 3H), 3.81 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.85 (s, 3H)。

実施例 2 (2 7 2)

8 - (N - (2 - メトキシエチル) - N - (2 - プチニル) アミノ) - 2 -
メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5 , 7 - ジヒドロ
20 フロ [3 , 4 - d] ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン ・ 塩酸塩

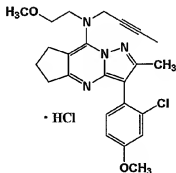


TLC: Rf 0.39 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.36 (m, 2H), 3.95 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.76 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.83 (s, 3H).

実施例 2 (273)

8 - (N - (2 - メトキシエチル) - N - (2 - ブチニル) アミノ) - 2 -
メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ
10 5H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩



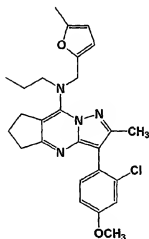
TLC: Rf 0.44 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.53 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.30 (m, 2H), 3.20 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J =

7.2Hz, 2H), 1.86 (t, $J = 2.4\text{Hz}$, 3H)。

実施例 2 (274)

- 8- (N-プロピル-N- (5-メチルフラン-2-イル) メチルアミノ)
 5-2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒ
 ドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

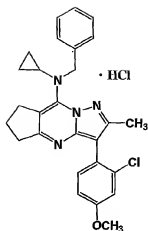


TLC: Rf 0.53 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

- NMR(300MHz, CDCl_3): δ 7.32 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 7.06 (d, $J = 2.7\text{Hz}$, 1H), 6.89
 10 (dd, $J = 2.7, 8.4\text{Hz}$, 1H), 5.99 (d, $J = 3.0\text{Hz}$, 1H), 5.85 (dd, $J = 1.6, 3.0\text{Hz}$, 1H), 4.78
 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 2.90 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 2.81 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H),
 2.39 (s, 3H), 2.22 (m, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 0.91 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H)。

実施例 2 (275)

- 15 8- (N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ) -2-メチル-3- (2-
 クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン
 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

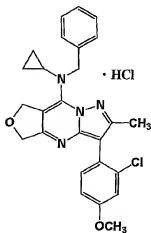


TLC : R_f 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.25 - 7.15 (m, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.00 - 6.94 (m, 1H), 5.39 (d, J = 14.7Hz, 1H), 5.27 (d, J = 14.7Hz, 1H),
 5 3.85 (s, 3H), 3.70 - 3.32 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.96 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.20 - 0.92 (m, 4H).

実施例 2 (276)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d]ピラゾロ [1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

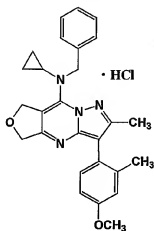


TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 3H), 7.15 - 7.09 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 4H)。

実施例 2 (277)

8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

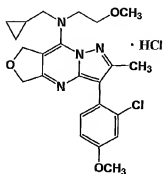


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.14 - 7.08 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.32 - 5.12 (m, 2H), 5.19 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 4H)。

実施例 2 (278)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -
2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒド
ローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



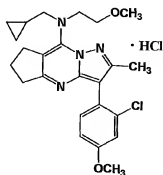
5 TLC : R f 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.30 (m) and 5.27 (s) total 4H, 4.32 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.72 - 3.67 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.71 (m, 2H), 0.36 (m, 2H).

10

実施例 2 (279)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -
2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒド
ロー5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



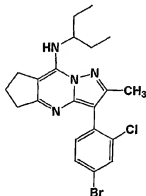
15

TLC : Rf 0.33 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.30 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.64 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.41 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.24 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.09 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.31 (m, 2H),

実施例 2 (280)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-プロモフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



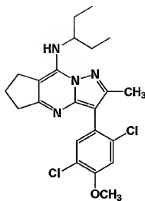
TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.65 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 2.1, 8.1Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.23 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.81 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.60 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H),

実施例 2 (281)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジクロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾ

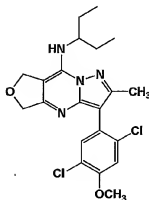
ロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC: Rf 0.65 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);
 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.40 (s, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.22 (br d, J = 10.5Hz, 1H),
 5 3.92 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 1H), 2.33 (s,
 3H), 2.15 (m, 2H), 1.58 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (282)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジクロロ-4-
 10 メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,
 5-a]ピリミジン

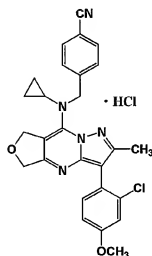


TLC: Rf 0.61 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.39 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.34 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 5.29 (m, 2H), 4.93 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.24 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 1.67 - 1.84 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H).

5 実施例 2 (283)

8 - (N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

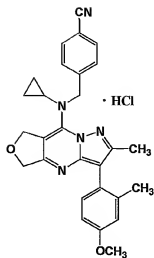


10 T L C : R f 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃): δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 0.84 (m, 4H).

15 実施例 2 (284)

8 - (N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

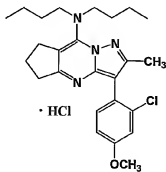


TLC: Rf 0.24 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.61 (d, J=7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J=7.8Hz, 2H), 7.17 (d, J=8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J=8.1, 2.7Hz, 1H), 5.40-5.20 (m, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 0.84 (m, 4H)。

実施例2 (285)

8-ジブチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



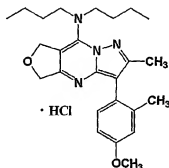
TLC: Rf 0.66 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.35 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.94 (dd, J=8.4, 2.1Hz, 1H), 3.84 (s and m, total 7H), 3.35 (m, 2H), 3.01 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 (quint, J=7.5Hz, 2H), 1.67 (quint, J=7.5Hz, 4H), 1.36 (sxt, J=7.5Hz, 2H), 0.95 (t, J=7.5Hz, 6H).

実施例 2 (286)

8-ジブチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリ

ミジン・塩酸塩



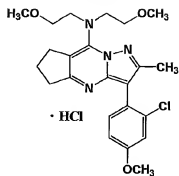
TLC: Rf 0.63 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.11 (d, J=8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J=8.4, 2.4Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.88 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.78 (quint, J=7.5Hz, 4H), 1.42 (sxt, J=7.5Hz, 4H), 1.00 (t, J=7.5Hz, 6H).

実施例 2 (287)

8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ5H-シクロペンタ[d]ピ

ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

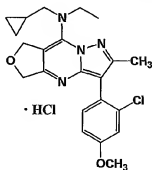


TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.35 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 4.15 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (t, J = 5.4Hz, 4H), 3.53 (m, 1H), 3.45 (m, 1H), 3.31 (s, 6H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J = 7.2Hz, 2H)。

実施例 2 (288)

10 8 - (N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



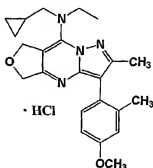
TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

15 NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.31 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.92

(m, 1H), 5.28 (s, 2H), 5.11 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.33 (s, 3H), 1.09 (m, 1H), 0.60 (m, 2H), 0.24 (m, 2H)。

実施例 2 (289)

- 5 8 - (N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロプロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

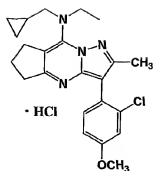


TLC: Rf 0.50 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.12 (m, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.82 (m, 1H), 5.38 (m, 2H), 5.31 (m, 2H), 3.99 (m, 2H), 3.83 (s and m, total 5H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.44 (m, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.72 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

実施例 2 (290)

- 15 8 - (N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

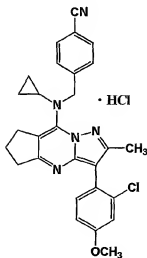


TLC: Rf 0.51 (ヘキサン：酢酸エチル＝2：1)；

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.59 (d, J = 6.6Hz, 2H),
 5 3.04 (t, J = 7.5Hz, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.16 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.03 (m, 1H), 0.50 (m, 2H), 0.15 (m, 2H)。

実施例 2 (291)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-
 10 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



T L C : R f 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

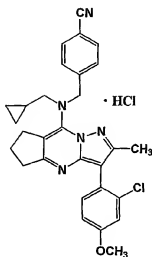
NMR (300MHz, DMSO-d₆) : δ 7.83 - 7.76 (m, 2H), 7.54 - 7.48 (m, 2H), 7.30 (dd, J = 8.7, 1.2Hz, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.02 - 6.96 (m, 1H), 5.12 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.06 (m, 2H), 2.94 - 2.78 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 0.79 - 0.70 (m, 2H), 0.61 (m, 2H)。

5

実施例 2 (292)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N- (4-シアノフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

10



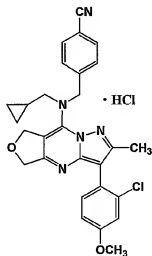
T L C : R f 0.37 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.69 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 7.34 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.96 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.10 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.18 - 1.02 (m, 1H), 0.70 - 0.58 (m, 2H), 0.22 - 0.10 (m, 2H)。

15

実施例 2 (293)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-シアノフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



5

TLC: Rf 0.21 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

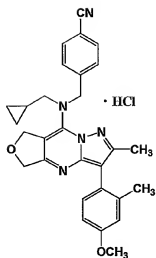
NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.68 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.52 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.26 (m, 4H), 5.14 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.45 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.05 (m, 1H), 0.68 - 0.56 (m, 2H), 0.18 - 0.10 (m, 2H)。

10

実施例 2 (294)

8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-シアノフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

15

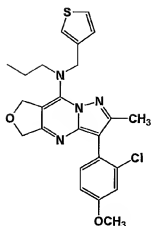


TLC : R_f 0.37 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.66 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.52 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.12 - 0.06 (m, 2H)。

実施例 2 (295)

8 - (N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル)メチルアミノ)-2-
 10 メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ
 フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

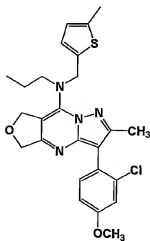
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.13 (m, 1H),

7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 0.9, 4.8Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H),

5 5.08 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.32 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (296)

8 - (N-プロピル-N-(5-メチルチオフェン-2-イル)メチルアミ
10 ノ) - 2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

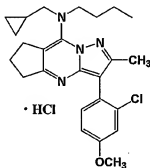


TLC: Rf 0.50 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.31 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J=2.4Hz, 1H), 6.90 (dd, J=2.4, 8.7Hz, 1H), 6.66 (d, J=3.3Hz, 1H), 6.56 (m, 1H), 5.02 - 5.17 (m, 4H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.64 (m, 2H),
 5 0.92 (t, J=7.5Hz, 3H).

実施例 2 (297)

8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロ
 10 ペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



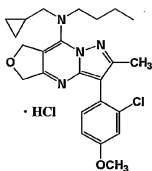
TLC: Rf 0.61 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.31 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.89 (dd, J=8.7, 2.1Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.69 (t, J=7.2Hz, 2H), 3.56 (d, J=7.2Hz, 2H),
 15 3.02 (m, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.15 (quint, J=7.2Hz, 2H), 1.58 (quint, J=7.5Hz, 2H), 1.34 (s, 3H), 1.02 (m, 1H), 0.91 (t, J=7.5Hz, 3H), 0.48 (m, 2H), 0.13 (m, 2H).

実施例 2 (298)

20 8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-

(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

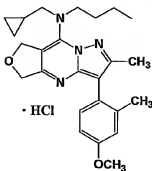


TLC: Rf 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

- 5 NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.93 (dd, J=8.4, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.70 (quint, J=7.2Hz, 2H), 1.39 (sxt, J=7.2Hz, 2H), 1.10 (m, 1H), 0.96 (t, J=7.2Hz, 3H), 0.62 (m, 2H), 0.25 (m, 2H).

10 実施例2 (299)

8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



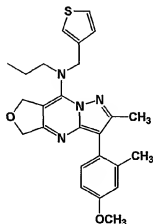
- 15 TLC: Rf 0.45 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.7, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.70 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.69 (m, 2H), 1.39 (s, 3H), 1.09 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.60 (m, 2H), 0.23 (m, 2H).

5

実施例 2 (300)

8- (N-プロピル-N- (チオフェン-3-イル) メチルアミノ) -2-
メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ
フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ビリミジン



10

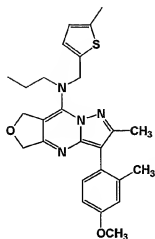
TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.28 (dd, J = 2.7, 5.1Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H),
7.13 (m, 1H), 6.97 (dd, J = 1.5, 5.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 3.0,
8.7Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.87 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.31 (m, 2H), 2.37
15 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (301)

8- (N-プロピル-N- (5-メチルチオフェン-2-イル) メチルアミ
ノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-

ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

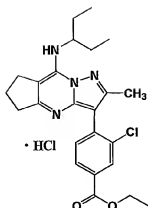


TLC: Rf 0.47 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81
 5 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 6.65 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 5.11 (s, 4H), 4.88 (s,
 2H), 3.83 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H),
 0.92 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (302)

10 8- (3-ベンチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-エトキシカルボニルフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

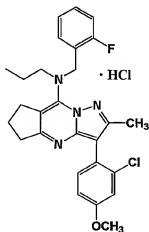


TLC : Rf 0.56 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 8.21 (d, J = 1.5Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 1.5, 7.8Hz, 1H),
7.56 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.30 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 4.38 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.00 (m,
5 1H), 3.34 - 3.64 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 1.65 -
1.96 (m, 4H), 1.41 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (303)

8 - (N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2 -
10 メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ
5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



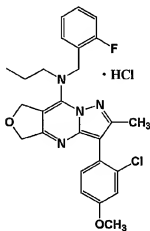
TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.35 (m, 2H), 7.10 - 6.92 (m, 5H), 5.16 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.60 - 3.34 (m, 2H), 3.03 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 0.94 (m, 3H)。

5

実施例 2 (304)

8- (N-プロピル-N- (2-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロピラゾロ [3, 4-d] ピリazo [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

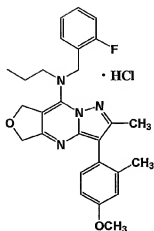
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.48 - 7.33 (m, 2H), 7.13 - 7.04 (m, 4H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.50 - 5.15 (m, 4H), 5.17 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.74 - 3.60 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.82 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15

実施例 2 (305)

8- (N-プロピル-N- (2-フルオロフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ

フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

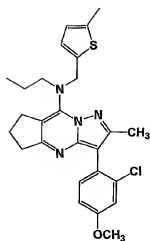


TLC: R_f 0.55 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.36 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.09 -
 5 6.96 (m, 3H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.13 (s, 2H),
 5.03 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.69
 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.92 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (306)

10 8-(N-プロピル-N-(5-メチルチオフェン-2-イル)メチルアミ
 ノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-
 ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

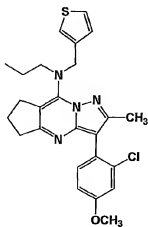


TLC : Rf 0.57 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.64 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.54 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.08 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H),

実施例 2 (307)

8 - (N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル)メチルアミノ)-2-
 10 メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-
 5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

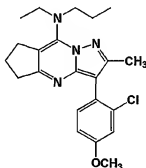


TLC: Rf 0.53 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.11 (m, 1H),
7.07 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J=1.5, 5.1Hz, 1H), 6.89 (dd, J=2.7, 8.7Hz, 1H),
4.85 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.90 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J=7.2Hz,
5 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 0.89 (t, J=7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (308)

8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ
-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペント
10 ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



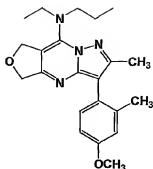
TLC: Rf 0.58 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.30 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.88
(dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (q, J=6.9Hz, 2H), 3.60-3.50 (m, 2H),
15 3.02-2.84 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.20-2.04 (m, 2H), 1.64-1.52 (m, 2H), 1.17 (t, J
=6.9Hz, 3H), 0.90 (t, J=6.9Hz, 3H)。

実施例 2 (309)

8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル
20 -4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-プロ[3,4-d]ピラゾ

ロ [1, 5-a] ピリミジン

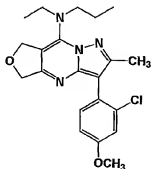


TLC: Rf 0.55 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (310)

- 10 8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



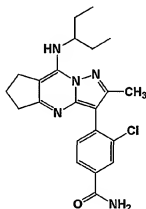
TLC: Rf 0.51 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 15 NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89

(dd, $J = 8.7, 2.7\text{Hz}$, 1H), 5.19 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.67 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 1.24 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 0.93 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H)。

5 実施例 2 (311)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - カルバモイルフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

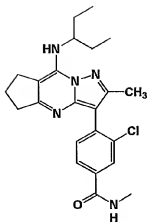


- 10 T L C : R f 0.53 (塩化メチレン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;
 NMR (300MHz, CDCl_3) : δ 7.96 (d, $J = 1.8\text{Hz}$, 1H), 7.70 (dd, $J = 8.1, 1.8\text{Hz}$, 1H), 7.50 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 6.26 (d, $J = 10.5\text{Hz}$, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 - 3.05 (m, 2H), 2.91 (t, $J = 7.8\text{Hz}$, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.22 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H)。

15

実施例 2 (312)

8 - (3 - ペンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - (N - メチルカルバモイル) フェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

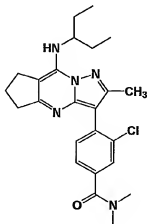


TLC : Rf 0.55 (塩化メチレン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.89 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.8, 1.8Hz, 1H),
 7.45 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.42 (brs, 1H), 6.26 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 -
 5 3.05 (m, 2H), 3.01 (d, J = 4.5Hz, 3H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.22 -
 2.09 (m, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (313)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4- (N,
 10 N-ジメチルカルバモイル) フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロ
 ペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

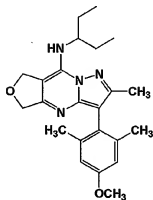


TLC: Rf 0.65 (塩化メチレン: 酢酸エチル = 10 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.56 (d, J = 1.5Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 1.5Hz, 1H), 6.26 (d, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.17 - 3.02 (m, 8H), 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.21 - 2.06 (m, 2H), 1.85 - 1.42 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例 2 (314)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,6-ジメチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



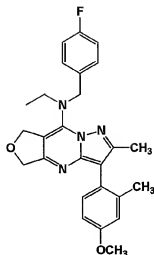
TLC: Rf 0.29 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 6.69 (s, 2H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.30 - 3.18 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.04 (s, 6H), 1.83 - 1.55 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (315)

8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフ

ロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

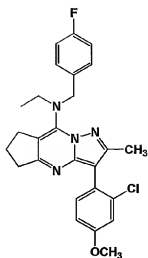


TLC: R_f 0.49 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl₃) : δ 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 -
 5 6.94 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.09 (s, 2H),
 4.96 - 4.80 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (s, 3H),
 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (316)

10 8 - (N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2-メ
 チル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5
 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

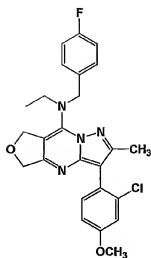


TLC: Rf 0.42 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1);

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.32 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.22 (m, 2H), 7.07 (d, J=2.4Hz, 1H), 7.04 - 6.94 (m, 2H), 6.90 (dd, J=8.4, 2.4Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.47 (q, J=7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.82 (t, J=7.2Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.16 - 1.98 (m, 2H), 1.18 (t, J=7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (317)

8 - (N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ) - 2-メ
 10 チル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフ
 ロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

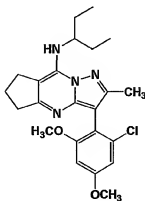


TLC: Rf 0.46 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 7.31 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.06 - 6.94 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.22 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (318)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4,6-ジ
10 メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾ
ロ[1,5-a]ピリミジン

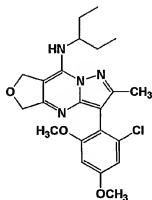


TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 6.67 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.45 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.23 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.07 (m, 2H), 2.90 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.52 - 1.80 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例 2 (319)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4, 6-ジメトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



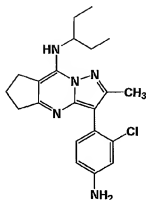
TLC : Rf 0.22 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 6.68 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.47 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.34 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 4.92 (d, J = 13.5Hz, 1H), 4.90 (d, J = 13.5Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 3.23 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.53 - 1.82 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

実施例 2 (320)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-アミノ

フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d], ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

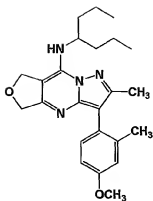


TLC: Rf 0.22 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

- 5 NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.82 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.63 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.87 - 3.62 (m, 3H), 3.12 - 3.03 (m, 2H), 2.95 - 2.86 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.07 (m, 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

10 実施例 2 (321)

8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

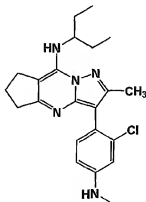


TLC : R f 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.78 - 1.38 (m, 8H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (322)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-クロロ-4-メチル
10 アミノフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ
[1, 5-a] ピリミジン



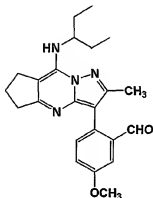
TLC : R f 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.73 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.56 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.70 (m, 2H), 3.12 - 3.02 (m, 2H), 2.95 - 2.80 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H).

5

実施例 2 (3 2 3)

8 - (3 - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - ホルミル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



10

TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

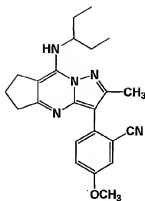
NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 9.85 (s, 1H), 7.55 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.23 (d, J = 9.6Hz, 1H), 3.93 - 3.74 (m) and 3.89 (s) total 4H, 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H),

15 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (3 2 4)

8 - (3 - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - シアノ - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,

5-a] ピリミジン

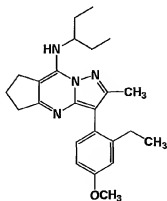


TLC: Rf 0.54 (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.46 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.18
 5 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 6.24 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.73 (m) and 3.86 (s) total
 4H, 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.15 (quint, J =
 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H).

実施例 2 (325)

10 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-エチル-4-メトキシ
 シフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,
 5-a]ピリミジン

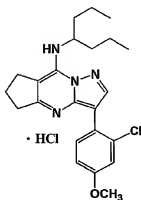


TLC : Rf 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m) and 3.83 (s) total 4H, 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.52 (q, J = 7.8Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.10 - 0.98 (m, 9H).

実施例 2 (326)

8 - (4-ヘプチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピ
 リミジン・塩酸塩



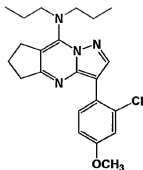
TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃) : δ 8.20 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.38 (d, J = 10.2Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 4.15 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 2.33 (m, 2H), 1.88 - 1.60 (m, 4H), 1.60 - 1.35 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (327)

8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a]

a] ピリミジン

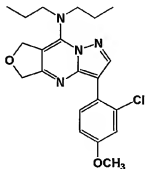


TLC: Rf 0.54 (ヘキサン: 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 8.32 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J =
 5 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.57 (m, 4H), 2.97 (m, 4H),
 2.17 (m, 2H), 1.66 - 1.50 (m, 4H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

実施例 2 (328)

8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェ
 10 ニル) - 5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピ
 リミジン



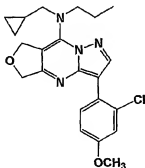
TLC: Rf 0.58 (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 8.35 (s, 1H), 7.72 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.04 (d, J =
 15 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.82 (s, 3H),

3.57 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 4H), 1.72 - 1.46 (m, 4H), 0.90 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H)。

実施例 2 (329)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ) - 3 - (2-クロ
5 ロー4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラ
ゾロ [1, 5-a] ピリミジン

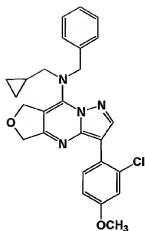


TLC: Rf 0.60 (ヘキサン:酢酸エチル = 2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 8.37 (s, 1H), 7.73 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 7.05 (d, $J =$
10 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, $J = 8.4, 2.7\text{Hz}$, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H),
3.64 - 3.50 (m, 4H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.93 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 0.58 -
0.44 (m, 2H), 0.20 - 0.08 (m, 2H)。

実施例 2 (330)

15 8 - (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ) - 3 - (2-クロ
ロー4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3, 4-d] ピラ
ゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC: Rf 0.52 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl₃): δ 8.42 (s, 1H), 7.74 (d, J=8.4Hz, 1H), 7.38 - 7.20 (m, 5H), 7.06 (d, J=2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J=8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H),
 5 4.95 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.43 (d, J=6.6Hz, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.58 - 0.46 (m, 2H),
 0.16 - 0.04 (m, 2H)。

実施例 2 (331)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミ
 10 ノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフ
 ロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン